

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局(43) 国際公開日  
2005 年 1 月 6 日 (06.01.2005)

PCT

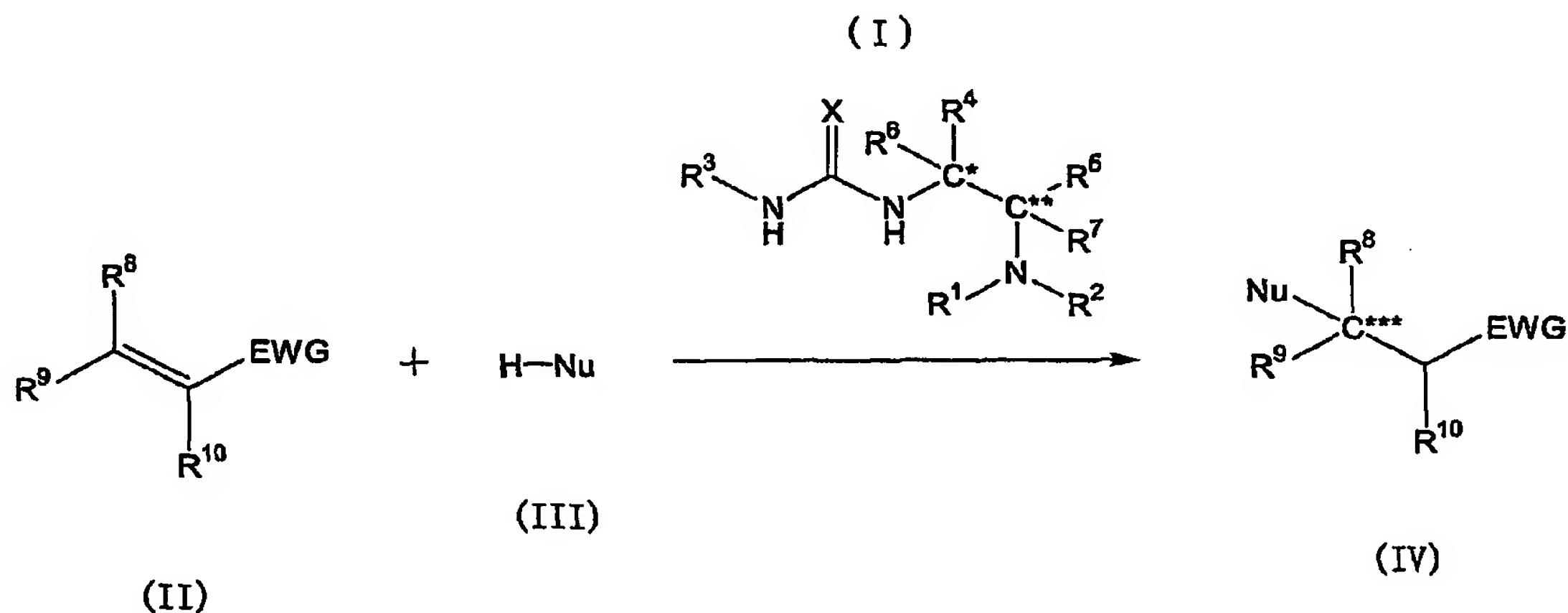
(10) 国際公開番号  
WO 2005/000803 A2

- (51) 国際特許分類<sup>7</sup>: C07D
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2004/009350
- (22) 国際出願日: 2004 年 6 月 25 日 (25.06.2004)
- (25) 国際出願の言語: 日本語
- (26) 国際公開の言語: 日本語
- (30) 優先権データ:  
特願2003-189096 2003 年 6 月 30 日 (30.06.2003) JP  
特願 2003-421688  
2003 年 12 月 18 日 (18.12.2003) JP
- (71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 住友化学株式会社 (SUMITOMO CHEMICAL COMPANY, LIMITED.) [JP/JP]; 〒1048260 東京都中央区新川二丁目 2 7 番 1 号 Tokyo (JP).
- (71) 出願人 および  
(72) 発明者 (日本, 米国についてのみ): 竹本 佳司 (TAKEMOTO, Yoshiji) [JP/JP]; 〒5200827 滋賀県大津市池の里 29-16 Shiga (JP).
- (74) 代理人: 高島 一 (TAKASHIMA, Hajime); 〒5410044 大阪府大阪市中央区伏見町四丁目 2 番 1 4 号 藤村大和生命ビル Osaka (JP).
- (81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.
- (84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

[続葉有]

(54) Title: ASYMMETRIC UREA COMPOUND AND PROCESS FOR PRODUCING ASYMMETRIC COMPOUND BY ASYMMETRIC CONJUGATE ADDITION REACTION WITH THE SAME AS CATALYST

(54) 発明の名称: 不斉尿素化合物およびこれを触媒として用いる不斉共役付加反応による不斉化合物の製造方法



(57) Abstract: A process for producing an asymmetric compound (IV), characterized by causing a compound (II) to add a nucleophilic reagent (III) through conjugate addition in the presence of an asymmetric urea compound (I). Also provided is a nonmetallic asymmetric catalyst capable of realizing asymmetric conjugate addition reaction which attain high yield and are highly stereoselective. The process is an advantageous process for producing an asymmetric compound by an asymmetric conjugate addition reaction in which the catalyst is used. [In the formulae, X represents oxygen or sulfur; C\*, C\*\*, and C\*\*\* each indicates asymmetric carbon; R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup>, and R<sup>10</sup> each represents optionally substituted lower alkyl, etc., provided that, for example, R<sup>4</sup> and R<sup>5</sup> may be bonded to each other to form an optionally substituted homocycle, etc.; R<sup>3</sup> represents optionally substituted aryl, etc.; R<sup>6</sup> and R<sup>7</sup> each represents hydrogen, etc.; Nu represents -CR<sup>16</sup>(COR<sup>17</sup>)(COR<sup>18</sup>) (wherein R<sup>16</sup>, R<sup>17</sup>, and R<sup>18</sup> each represents optionally substituted lower alkyl, etc.), etc.; and EWG represents an electron-withdrawing group.]

[続葉有]



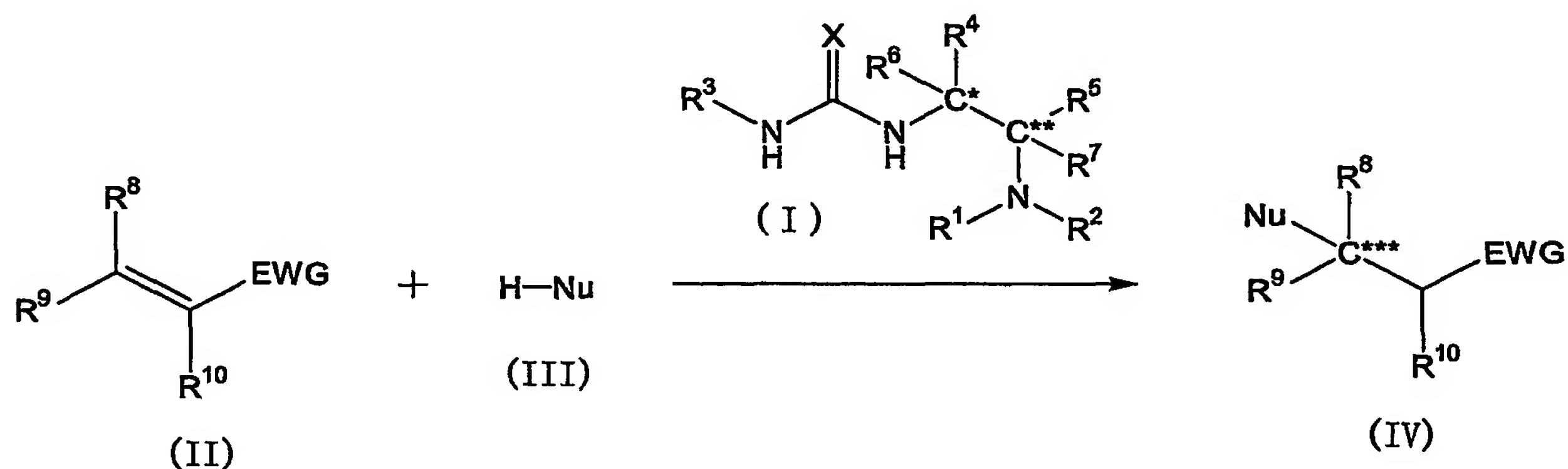
添付公開書類:

— 国際調査報告書なし；報告書を受け取り次第公開される。

2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(57) 要約:

本発明は、不斉尿素化合物 (I) の存在下、化合物 (II) に求核試薬 (III) を共役付加させることを特徴とする、不斉化合物 (IV) の製造方法に関する。本発明によれば、高収率・高立体選択的な不斉共役付加反応を実現し得る非金属不斉触媒、およびこれを用いた不斉共役付加反応による不斉化合物の有利な製造方法を提供することができる。



〔式中、Xは酸素原子または硫黄原子を示し； $C^*$ 、 $C^{**}$ および $C^{***}$ は不斉炭素を示し； $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^8$ 、 $R^9$ および $R^{10}$ は置換基を有していてもよい低級アルキル基等を示すか、あるいは $R^4$ と $R^5$ 等是一緒になって、置換基を有していてもよい同素環等を形成してもよく； $R^3$ は置換基を有していてもよいアリール基等を示し； $R^6$ および $R^7$ は水素原子等を示し；Nuは $-CR^{16}$  ( $CO R^{17}$ ) ( $CO R^{18}$ ) ( $R^{16}$ 、 $R^{17}$ および $R^{18}$ は置換基を有していてもよい低級アルキル基等を示す。) 等を示し；EWGは電子吸引基を示す。〕